

特 許 協 力 条 約

PCT

国際予備審査報告

(法第12条、法施行規則第56条)
[PCT 36条及びPCT規則70]

REC'D 03 FEB 2004

WIPO PCT

出願人又は代理人 の書類記号 ONF-4505PCT	今後の手続きについては、国際予備審査報告の送付通知(様式PCT/ IPEA/416)を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JPO3/02478	国際出願日 (日.月.年) 04.03.2003	優先日 (日.月.年) 05.03.2002
国際特許分類(IPC) Int. Cl ⁷ C07D207/27, 409/06, 417/06, 417/12, 413/06, 263/24, 405/12, 409/12, 405/06, A61K31/4015, 31/4025, 31/427, 31/421, 31/422, A61P1/00, 1/16, 7/00, 9/00, 9/08, 9/10, 9/12, 11/00, 11/06, 11/08, 13/12, 15/06, 15/10,		
出願人(氏名又は名称) 小野薬品工業株式会社		

1. 国際予備審査機関が作成したこの国際予備審査報告を法施行規則第57条(PCT 36条)の規定に従い送付する。
2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 6 ページからなる。 <input type="checkbox"/> この国際予備審査報告には、附属書類、つまり補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関に対してした訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面も添付されている。 (PCT規則70.16及びPCT実施細則第607号参照) この附属書類は、全部で _____ ページである。
3. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。 I <input checked="" type="checkbox"/> 国際予備審査報告の基礎 II <input type="checkbox"/> 優先権 III <input checked="" type="checkbox"/> 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成 IV <input type="checkbox"/> 発明の単一性の欠如 V <input checked="" type="checkbox"/> PCT 35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明 VI <input checked="" type="checkbox"/> ある種の引用文献 VII <input type="checkbox"/> 国際出願の不備 VIII <input type="checkbox"/> 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 08.09.2003	国際予備審査報告を作成した日 14.01.2004		
名称及びあて先 日本国特許庁(IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官(権限のある職員)	4P	8615
	内藤 伸一 印		
電話番号 03-3581-1101 内線 3492			

様式PCT/IPEA/409(表紙)(1998年7月)

I. 国際予備審査報告の基礎

1. この国際予備審査報告は下記の出願書類に基づいて作成された。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に
 応答するために提出された差し替え用紙は、この報告書において「出願時」とし、本報告書には添付しない。
 PCT規則70.16, 70.17)

☒ 出願時の国際出願書類

- ☐ 明細書 第 _____ ページ、 出願時に提出されたもの
 明細書 第 _____ ページ、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
 明細書 第 _____ ページ、 _____ 付の書簡と共に提出されたもの
- ☐ 請求の範囲 第 _____ 項、 出願時に提出されたもの
 請求の範囲 第 _____ 項、 PCT19条の規定に基づき補正されたもの
 請求の範囲 第 _____ 項、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
 請求の範囲 第 _____ 項、 _____ 付の書簡と共に提出されたもの
- ☐ 図面 第 _____ ページ/図、 出願時に提出されたもの
 図面 第 _____ ページ/図、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
 図面 第 _____ ページ/図、 _____ 付の書簡と共に提出されたもの
- ☐ 明細書の配列表の部分 第 _____ ページ、 出願時に提出されたもの
 明細書の配列表の部分 第 _____ ページ、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
 明細書の配列表の部分 第 _____ ページ、 _____ 付の書簡と共に提出されたもの

2. 上記の出願書類の言語は、下記に示す場合を除くほか、この国際出願の言語である。

上記の書類は、下記の言語である _____ 語である。

- ☐ 国際調査のために提出されたPCT規則23.1(b)にいう翻訳文の言語
☐ PCT規則48.3(b)にいう国際公開の言語
☐ 国際予備審査のために提出されたPCT規則55.2または55.3にいう翻訳文の言語

3. この国際出願は、ヌクレオチド又はアミノ酸配列を含んでおり、次の配列表に基づき国際予備審査報告を行った。

- ☐ この国際出願に含まれる書面による配列表
☐ この国際出願と共に提出された磁気ディスクによる配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された書面による配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された磁気ディスクによる配列表
☐ 出願後に提出した書面による配列表が出願時における国際出願の開示の範囲を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった
☐ 書面による配列表に記載した配列と磁気ディスクによる配列表に記載した配列が同一である旨の陳述書の提出があった。

4. 補正により、下記の書類が削除された。

- ☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 図面の第 _____ ページ/図

5. ☐ この国際予備審査報告は、補充欄に示したように、補正が出願時における開示の範囲を越えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c) この補正を含む差し替え用紙は上記1.における判断の際に考慮しなければならず、本報告に添付する。)

1. 次に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

- ☒ 請求の範囲 1 - 20

☐ この国際出願又は請求の範囲 _____ は、国際予備審査をすることを要しない
次の事項を内容としている（具体的に記載すること）。

- 請求の範囲 1-20に係る発明は、一般式 (I) で表される化合物又はそれを有効成分とする医薬組成物の発明であるが、同化合物は、極めて広範囲かつ多彩な化合物を包含し、しかも、除く部分が複雑に入り組んでおり、そのすべてについて、完全な調査を行うことは困難である。一方、特許協力条約第 6 条の意味において明細書に裏付けられ、また、特許協力条約第 5 条の意味において明細書に開示されているものは、同化合物の中のごく一部分に過ぎない。

したがって、請求の範囲1-20及び明細書は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない。

そこで、先の国際調査報告では、請求の範囲1-20の発明について、明細書に具体的に記載された化合物に基づいて、合理的な負担の範囲内で、先行技術文献調査を行ったので、この調査の範囲で、国際予備審査を行うこととする。

- ☐ 請求の範囲 について、国際調査報告が作成されていない。

2. ヌクレオチド又はアミノ酸の配列表が実施細則の附属書C（塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のためのガイドライン）に定める基準を満たしていないので、有効な国際予備審査をすることができない。

- ☐ 書面による配列表が提出されていない又は所定の基準を満たしていない。
- ☐ 磁気ディスクによる配列表が提出されていない又は所定の基準を満たしていない。

V. 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲	18-20	有
	請求の範囲	1-17	無
進歩性 (IS)	請求の範囲		有
	請求の範囲	1-20	無
産業上の利用可能性 (IA)	請求の範囲	1-20	有
	請求の範囲		無

2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

- 文献 1) EP 4 712 01 A
2) JP 2 001-2 337 92 A
3) JP 2 001-2 203 57 A
4) JP 2 001-1 812 10 A

請求の範囲 1-17 の発明は、国際調査報告で引用された文献 1 により新規性を有さない。文献 1 には、本願発明化合物に該当する化合物が記載されている。

請求の範囲 1-20 の発明は、国際調査報告で引用された文献 2-4 により進歩性を有さない。文献 2-4 には、プロスタグランジン E₂ や E₄ に選択的なアゴニストとして有用な種々のアザプロスタグランジン誘導体が記載されており、本願発明化合物は、これらの誘導体と化学構造上類似するものであって、当業者が文献 2-4 の記載に基づいて容易に想到し得たものである。

VI. ある種の引用文献

1. ある種の公表された文書 (PCT規則70.10)

出願番号 特許番号	公知日 (日. 月. 年)	出願日 (日. 月. 年)	優先日 (有効な優先権の主張) (日. 月. 年)
WO 03/009872 A EX	06. 02. 2003	22. 07. 2002	23. 07. 2001
WO 03/008377 A EX	30. 01. 2003	08. 07. 2002	16. 07. 2001
WO 02/42268 A EX	30. 05. 2002	05. 11. 2001	27. 11. 2000
WO 03/007941 A EX	30. 01. 2003	11. 07. 2002	16. 07. 2001
WO 02/24647 A EA	28. 03. 2002	20. 09. 2001	21. 09. 2000

2. 書面による開示以外の開示 (PCT規則70.9)

書面による開示以外の開示の種類	書面による開示以外の開示の日付 (日. 月. 年)	書面による開示以外の開示に言及している 書面の日付 (日. 月. 年)
-----------------	------------------------------	--

補充欄 (いずれかの欄の大きさが足りない場合に使用すること)

第 欄の続き

国際特許分類 (I P C) の続き

19/02, 19/08, 19/10, 25/00, 27/02, 29/00, 35/00, 37/02, 43/00

Translation

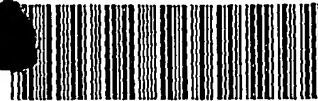
PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

PCT Application
PCT/JP2003/002478



Applicant's or agent's file reference ONF-4505PCT	FOR FURTHER ACTION See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)	
International application No. PCT/JP2003/002478	International filing date (day/month/year) 04 March 2003 (04.03.2003)	Priority date (day/month/year) 05 March 2002 (05.03.2002)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07D207/27, 409/06, 417/06, 417/12, 413/06, 263/24, 405/12, 409/12, 405/06, A61K31/4015, 31/4025, 31/427, 31/421, 31/422, A61P1/00, 1/16, 7/00, 9/00, 9/08, 9/10, 9/12, 11/00, 11/06, 11/08, 13/12, 15/06, 15/10, 19/02, 19/08, 19/10, 25/00, 27/02, 29/00, 35/00, 37/02, 43/00		
Applicant ONO PHARMACEUTICAL CO., LTD.		

1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.
2. This REPORT consists of a total of 6 sheets, including this cover sheet.
- ☐ This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).
- These annexes consist of a total of _____ sheets.

3. This report contains indications relating to the following items:

- I ☒ Basis of the report
- II ☐ Priority
- III ☒ Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
- IV ☐ Lack of unity of invention
- V ☒ Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
- VI ☒ Certain documents cited
- VII ☐ Certain defects in the international application
- VIII ☐ Certain observations on the international application

Date of submission of the demand 08 September 2003 (08.09.2003)	Date of completion of this report 14 January 2004 (14.01.2004)
Name and mailing address of the IPEA/JP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

Form PCT/IPEA/409 (cover sheet) (July 1998)

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International Application No.

PCT/JP2003/002478

I. Basis of the report

1. With regard to the elements of the international application:*

- ☒ the international application as originally filed
- ☐ the description:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the claims:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, as amended (together with any statement under Article 19
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the drawings:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the sequence listing part of the description:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____

2. With regard to the language, all the elements marked above were available or furnished to this Authority in the language in which the international application was filed, unless otherwise indicated under this item. These elements were available or furnished to this Authority in the following language _____ which is:

- ☐ the language of a translation furnished for the purposes of international search (under Rule 23.1(b)).
- ☐ the language of publication of the international application (under Rule 48.3(b)).
- ☐ the language of the translation furnished for the purposes of international preliminary examination (under Rule 55.2 and/or 55.3).

3. With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application, the international preliminary examination was carried out on the basis of the sequence listing:

- ☐ contained in the international application in written form.
- ☐ filed together with the international application in computer readable form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in written form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in computer readable form.
- ☐ The statement that the subsequently furnished written sequence listing does not go beyond the disclosure in the international application as filed has been furnished.
- ☐ The statement that the information recorded in computer readable form is identical to the written sequence listing has been furnished.

4. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages _____
- ☐ the claims, Nos. _____
- ☐ the drawings, sheets/fig _____

5. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).**

* Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report since they do not contain amendments (Rule 70.16 and 70.17).

** Any replacement sheet containing such amendments must be referred to under item 1 and annexed to this report.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International Application No.

PCT/JP2003/002478

III. Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability

1. The questions whether the claimed invention appears to be novel, to involve an inventive step (to be non obvious), or to be industrially applicable have not been examined in respect of:

☐ the entire international application.

☒ claims Nos. 1-20

because:

☐ the said international application, or the said claims Nos. _____
relate to the following subject matter which does not require an international preliminary examination (*specify*):

☒ the description, claims or drawings (*indicate particular elements below*) or said claims Nos. 1-20
are so unclear that no meaningful opinion could be formed (*specify*):

SEE SUPPLEMENTAL SHEET

☐ the claims, or said claims Nos. _____ are so inadequately supported
by the description that no meaningful opinion could be formed.

☐ no international search report has been established for said claims Nos. _____

2. A meaningful international preliminary examination cannot be carried out due to the failure of the nucleotide and/or amino acid sequence listing to comply with the standard provided for in Annex C of the Administrative Instructions:

☐ the written form has not been furnished or does not comply with the standard.

☐ the computer readable form has not been furnished or does not comply with the standard.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.
PCT/JP 03/02478

Supplemental Box

(To be used when the space in any of the preceding boxes is not sufficient)

Continuation of: III. 1

The inventions set forth in claims 1-20 are inventions of compounds represented by general formula (I) or medicinal compositions containing the same as an active ingredient. However, these compounds encompass an exceedingly broad range of varied compounds. Moreover, the exceptions are also complex, and it would be difficult to perform a complete search for all of these. In addition, only a small portion of these compounds are supported by the description in the sense of PCT Article 6 and disclosed in the description in the sense of PCT Article 5.

Therefore, claims 1-20 and the description do not satisfy the conditions necessary to enable a meaningful international search.

Accordingly, for the earlier international search report, a search of the prior art literature was performed within the scope of reasonable responsibility, with reference to compounds specifically disclosed in the description, and an international preliminary examination has been carried out within the scope of this search.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International Application No.

PCT/JP 03/02478

V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

1. Statement

Novelty (N)	Claims	18-20	YES
	Claims	1-17	NO
Inventive step (IS)	Claims		YES
	Claims	1-20	NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-20	YES
	Claims		NO

2. Citations and explanations

Document 1: EP 471201 A

Document 2: JP 2001-233792 A

Document 3: JP 2001-220357 A

Document 4: JP 2001-181210 A

The inventions set forth in claims 1-17 are not novel over document 1, cited in the international search report. Document 1 discloses compounds which fall within the scope of the compounds described in these inventions in the present application.

The inventions set forth in claims 1-20 do not involve an inventive step in the light of documents 2-4, cited in the international search report. Documents 2-4 disclose various azaprostaglandin derivatives useful as selective agonists for prostaglandin E2 and/or E4, and the compounds disclosed in the inventions in the present application are analogous in chemical structure to these derivatives and could be derived easily by a person skilled in the art with reference to the disclosures in documents 2-4.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/JP2003/002478

VI. Certain documents cited

1. Certain published documents (Rule 70.10)

<u>Application No. Patent No.</u>	<u>Publication date (day/month/year)</u>	<u>Filing date (day/month/year)</u>	<u>Priority date (valid claim) (day/month/year)</u>
WO 03/009872 A EX	06 February 2003 (06.02.2003)	22 July 2002 (22.07.2002)	23 July 2001 (23.07.2001)
WO 03/008377 AEX	30 January 2003 (30.01.2003)	08 July 2002 (08.07.2002)	16 July 2001 (16.07.2001)
WO 02/42268 AEX	30 May 2002 (30.05.2002)	05 November 2001 (05.11.2001)	27 November 2000 (27.11.2000)
WO 03/007941 A EX	30 January 2003 (30.01.2003)	11 July 2002 (11.07.2002)	16 July 2001 (16.07.2001)
WO 02/24647 A EA	28 March 2002 (28.03.2002)	20 September 2001 (20.09.2001)	21 September 2000 (21.09.2000)

2. Non-written disclosures (Rule 70.9)

<u>Kind of non-written disclosure</u>	<u>Date of non-written disclosure (day/month/year)</u>	<u>Date of written disclosure referring to non-written disclosure (day/month/year)</u>